

S1 1 PN=JP 61069721

1/7/1

DIALOG(R)File 351:Derwent WPI
(c) 2003 Thomson Derwent. All rts. reserv.

004630465

WPI Acc No: 1986-133808/*198621*

**Anti-mycotic compsn. providing long-lasting effects - contains 2-naphthyl
N-methyl-N-(3-tolyl)thiocarbamate, MEK, triacetin and alcohol**

Patent Assignee: KAO CORP (KAOS)

Number of Countries: 001 Number of Patents: 002

Patent Family:

Patent No	Kind	Date	Applicat No	Kind	Date	Week
JP 61069721	A	19860410	JP 84191962	A	19840913	198621 B
JP 93077648	B	19931027	JP 84191962	A	19840913	199346

Priority Applications (No Type Date): JP 84191962 A 19840913

Patent Details:

Patent No	Kind	Lan	Pg	Main IPC	Filing Notes
-----------	------	-----	----	----------	--------------

JP 61069721	A		3		
-------------	---	--	---	--	--

JP 93077648	B		3	A61K-031/27	Based on patent JP 61069721
-------------	---	--	---	-------------	-----------------------------

Abstract (Basic): JP 61069721 A

Compsn. contains 2-naphthyl-N-methyl N-(3-tolyl)-thiocarbamate (I)
0.5-3 wt%, MEK 5-30 wt%, triacetin 5-40 wt% and alcohol balance.
Composition may also contain 1-10 wt% 2-12C carboxylic acid
monoglycerine and/or diglyceride.

Specifically pref. alcohols are ethanol, isopropanol,
hexadecylalcohol or isostearyl-alcohol. 2-12C carboxylic acid
monoglyceride and/or diglyceride is used as penetration aid (into skin,
hair, nails), and examples are acetic acid monoglyceride, acetic acid
diglyceride, propionic acid monoglyceride, propionic acid diglyceride,
butyric acid monoglyceride, butyric acid diglyceride, valeric acid
monoglyceride, valeric acid diglyceride, etc. (3pp Dwg.No.0/0)

Derwent Class: B05; C03

International Patent Class (Main): A61K-031/27

International Patent Class (Additional): A61K-009/08; A61K-047/08;

A61K-047/10; A61K-047/14; C07C-155/02

⑩ 日本国特許庁(JP)

⑪ 特許出願公開

⑫ 公開特許公報(A)

昭61-69721

⑬ Int.Cl.⁴

識別記号

庁内整理番号

⑭ 公開 昭和61年(1986)4月10日

A 61 K 31/27
9/08
47/00

A D B

7330-4C
6742-4C
6742-4C

// C 07 C 155/02

審査請求 未請求 発明の数 2 (全3頁)

⑮ 発明の名称 抗真菌組成物

⑯ 特 願 昭59-191962

⑰ 出 願 昭59(1984)9月13日

⑱ 発 明 者 原 健 次 宇都宮市氷室町1022-53
⑲ 出 願 人 花王石鹼株式会社 東京都中央区日本橋茅場町1丁目14番10号
⑳ 代 理 人 弁理士 有賀 三幸 外2名

明 細 書

1. 発明の名称

抗真菌組成物

2. 特許請求の範囲

1. 次の成分(a)~(d)を含有する抗真菌組成物。

(a) トルナフテート 0.5~3 重量%

(b) メチルエチルケトン 5~30 重量%

(c) トリアセチン 5~40 重量%

(d) アルコール バランス

2. 次の成分(a)~(e)を含有する抗真菌組成物。

(a) トルナフテート 0.5~3 重量%

(b) メチルエチルケトン 5~30 重量%

(c) トリアセチン 5~40 重量%

(d) アルコール バランス

(e) 炭素数2~12のカルボン酸のモノグリセリド及び/又はジグリセリド 1~10 重量%

3. 発明の詳細な説明

〔産業上の利用分野〕

本発明は抗真菌組成物に関する。

〔従来の技術〕

トルナフテートは2-ナフチル-N-メチル-N-(3-トリル)-チオカルバメートの化学名を持つ抗真菌剤で、真菌類、特に白癬菌、小胞子菌、表皮糸状菌類に対し選択的に抗菌性を示し、極低濃度でも有効であることから広く抗真菌剤として用いられている。そして、このトルナフテートは、通常はワセリンあるいはアルコール類を基剤として用いられている。

〔発明が解決しようとする問題点〕

しかしながら、ワセリンを基剤として用いたトルナフテート含有軟膏は、患部適用後いつまでもベトベトして使用感が悪いと共に、薬物の基剤からの溶出速度が遅く、さらに靴下等に付着するなどして、充分その効果が得られない欠点があつた。また、アルコール類を基剤として用いたトルナフテート含有液剤は、患部適用後短時間にアルコール類が揮発してしまい有効成分であるトルナフテートが微細晶として析出し充分な効果が得られない欠点があつた。

〔問題点を解決するための手段〕

本発明者は、斯かる欠点を克服すべく鋭意研究を重ねた結果、トルナフテートの増剤としてアルコールにメチルエチルケトン及びトリアセチンを配合せしめたものを使用すれば、上記欠点がすべて解決され、患部適用後いつまでもべとつかず、トルナフテートが微細晶として析出せず、かつ、患部で長時間その効果を発揮できる抗真菌組成物が得られることを見出し、第一発明を完成した。また、トルナフテートの増剤として、アルコール、メチルエチルケトン及びトリアセチンよりなる配合系に、炭素数2～12のカルボン酸のモノグリセリド及び／又はジグリセリドを添加することにより、更に治療効果の優れた抗真菌組成物が得られることを見出し、第二発明を完成した。

すなわち本発明の第一発明は、次の成分(a)～(d)

(a)トルナフテート	0.5～3重量%
(b)メチルエチルケトン	5～30重量%
(c)トリアセチン	5～40重量%
(d)アルコール	バランス

本発明に用いられる炭素数2～12のカルボン酸のモノグリセリド及び／又はジグリセリドは、トルナフテートの溶解助剤及び皮膚、毛髪、爪への浸透助剤として配合されるもので、例えば酢酸モノグリセリド、酢酸ジグリセリド、プロピオン酸モノグリセリド、プロピオン酸ジグリセリド、酪酸モノグリセリド、酪酸ジグリセリド、吉草酸モノグリセリド、吉草酸ジグリセリド、カブロン酸モノグリセリド、カブロン酸ジグリセリド、エナント酸モノグリセリド、エナント酸ジグリセリド、カプリル酸モノグリセリド、カプリル酸ジグリセリド、ペラルゴン酸モノグリセリド、ペラルゴン酸ジグリセリド、カプリン酸モノグリセリド、カプリン酸ジグリセリド、ウンデカン酸モノグリセリド、ウンデカン酸ジグリセリド、ラウリン酸モノグリセリド、ラウリン酸ジグリセリド、2-エチルヘキサノ酸モノグリセリド、2-エチルヘキサノ酸ジグリセリド、モノカプリル酸モノカブロン酸ジグリセリド、モノカプリル酸モノラウリン酸ジグリセリド、モノカブロン酸モノラウ

リン酸ジグリセリド、アセチンフアット、ヤシ油、パーム核油から得られるモノまたはジグリセリドが挙げられる。これらの炭素数2～12のカルボン酸のモノグリセリド及び／又はジグリセリドは、本発明の抗真菌組成物に0～10重量%の範囲で配合しうるが、その効果の点から1～10重量%の範囲がより好ましい。

また、本発明の第二発明は、次の成分(a)～(e)

(a)トルナフテート	0.5～3重量%
(b)メチルエチルケトン	5～30重量%
(c)トリアセチン	5～40重量%
(d)アルコール	バランス
(e)炭素数2～12のカルボン酸のモノグリセリド及び／又はジグリセリド	1～10重量%

を含有する抗真菌組成物を提供するものである。

本発明に用いられるアルコールとしては、炭素数1～20の脂肪族アルコールであつて、例えばエチルアルコール、メチルアルコール、プロピルアルコール、イソプロピルアルコール、ラウリルアルコール、ヘキサデシルアルコール、イソステアarylアルコール、オクタルドデカノール等が挙げられ、就中、エチルアルコール、イソプロピルアルコール、ヘキサデシルアルコール、イソステアarylアルコールが好ましい。

〔作用〕

本発明の抗真菌組成物は、トルナフテートの低沸点可溶化剤としてメチルエチルケトン、中沸点可溶化剤としてトリアセチンが配合されており、本発明品を患部に適用した場合、短時間でトルナフテートが析出することがない。更に、トルナフテートの薬効が最大限に発揮できるよう、皮膚への浸透性を高める炭素数2～12のカルボン酸のモノグリセリド及び／又はジグリセリドが配合されている。これらの可溶化剤、浸透助剤とトルナフテートの効果が相俟つて強力な抗真菌作用を発揮するものである。

〔発明の効果〕

以上の如く、本発明の抗皮膚組成物は、皮膚、毛髪、爪に対して外用で充分その殺菌作用を発揮し、副作用も見られず極めて優れたものである。

〔実施例〕

以下に実施例をあげて本発明を具体的に説明するが、本発明は、これら実施例に制約されるものではない。

実施例 1

① トルナフテート	1.0 重量部
② カプリン酸モノグリセリド	5.0
③ メチルエチルケトン	25.0
④ トリアセチン	25.0
⑤ エチルアルコール	44.0

①～⑤を褐色ガラス瓶に秤量し、室温で①が完全に溶解するまで攪拌したのち容器に充填して製品とする。本品を皮膚に塗布した場合でも、長時間にわたり結晶の析出は観察されなかつた。

しかし、③④の代りにエチルアルコールを50重量部加えたものは、皮膚に塗布した場合短時間で結晶が析出した。

実施例 2

① トルナフテート	2.0 重量部
② カプリン酸モノグリセリド/ カプリン酸モノグリセリド(70:30)の混合物	8.0
③ メチルエチルケトン	15.0
④ トリアセチン	30.0
⑤ エチルアルコール	45.0

実施例 1 と同様にして製品とする。本品を皮膚に塗布した場合でも、長時間にわたり結晶の析出は観察されなかつた。

実施例 3

① トルナフテート	1.0 重量部
② メチルエチルケトン	25.0
③ トリアセチン	25.0
④ イソプロピルアルコール	49.0

実施例 1 と同様にして製品とする。本品を皮膚に塗布した場合でも、長時間にわたり結晶の析出は観察されなかつた。

実施例 4

年齢19～35才の足白癬(汗疱状白癬、趾間白癬)に罹患している15名を対照とし、初診後左右の足にほぼ同等の皮疹を有する患者に、二重盲法により、A、B、Cの薬剤を1日2回朝夕単回塗布させた。そして、皮疹の改善度を、試験開始後2週間目、4週間目に観察し、下記方法により判定した。結果を第1表に示す。

使用薬剤

A: 実施例 1 の組成物(本発明品)

B: 実施例 1 の組成物より、カプリン酸モノグリセリドを除き、エチルアルコールを49重量部としたもの(本発明品)

C: トルナフテート1.0%を含有するワセリン軟膏(比較品)

効果の判定法

有効: 皮疹の消失または著明なる改善が認められるもの

やや有効: 皮疹の改善が認められるもの

無効: 皮疹が不変で改善が認められないもの

増悪: 皮疹に増悪が認められたもの

第1表

単位: 名

判定 使用薬剤		判定			
		有効	やや有効	無効	増悪
2週間後	A	6	3	1	0
	B	4	3	3	0
	C	2	4	4	0
4週間後	A	8	1	1	0
	B	5	3	2	0
	C	2	4	4	0

ただし、比較品Cは使用後ベトベトして使用しづらいものであつた。

以上